

PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM

Internationales Büro



INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICH NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation <sup>7</sup> : <b>C07D 417/04, A61K 31/425, 31/42</b>		A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: <b>WO 00/29409</b>
			(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: <b>25. Mai 2000 (25.05.00)</b>
(21) Internationales Aktenzeichen: <b>PCT/EP99/08468</b>		(81) Bestimmungsstaaten: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).	
(22) Internationales Anmeldedatum: 5. November 1999 (05.11.99)			
(30) Prioritätsdaten: 198 53 002.1 17. November 1998 (17.11.98) DE			
(71) Anmelder ( <i>für alle Bestimmungsstaaten ausser US</i> ): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen (DE).			
(72) Erfinder; und		Veröffentlicht	
(75) Erfinder/Anmelder ( <i>nur für US</i> ): BARTEL, Stephan [DE/DE]; Zu den Birken 26, D-51515 Kürten (DE). RADDATZ, Siegfried [DE/DE]; Jakob-Böhme-Strasse 21, D-51065 Köln (DE). HÄRTER, Michael [DE/DE]; Maushäuschen 15, D-42489 Wülfrath (DE). ROSENTRETER, Ulrich [DE/DE]; Obere Rutenbeck 6, D-42439 Wuppertal (DE). WILD, Hanno [DE/DE]; Ausblick 128, D-42113 Wuppertal (DE). ENDERMANN, Rainer [DE/DE]; In den Birken 152a, D-42113 Wuppertal (DE). KROLL, Hein-Peter [DE/DE]; Pahlkestrasse 96, D-42115 Wuppertal (DE).		Mit internationalem Recherchenbericht.	
(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).			

(54) Title: NOVEL HETEROCYCLYL-SUBSTITUTED OXAZOLIDONE DERIVATIVES

(54) Bezeichnung: NEUE HETEROCYCLYL-SUBSTITUIERTE OXAZOLIDON-DERivate

(57) Abstract

The invention relates to novel heterocyclyl-substituted oxazolidone derivatives, to a method for producing them, to pharmaceutical compositions containing them and to their use for producing medicaments, especially for producing antibacterial medicaments for treating human beings and animals.

(57) Zusammenfassung

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Heterocyclyl-substituierte Oxazolidon-Derivate, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie umfassende pharmazeutische Zusammensetzungen sowie ihre Verwendung zur Herstellung von Arzneimitteln, insbesondere zur Herstellung von antibakteriellen Arzneimitteln zur Behandlung von Menschen und Tieren.

**LEDIGLICH ZUR INFORMATION**

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

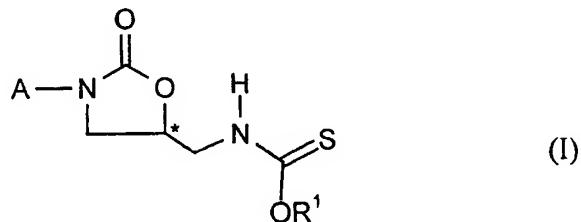
AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mali	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	MN	Mongolei	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MR	Mauretanien	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MW	Malawi	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CU	Kuba	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR	Liberia	SG	Singapur		
EE	Estland						

Neue Heterocycll-substituierte Oxazolidon-Derivate

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Heterocycll-substituierte Oxazolidon-Derivate, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie umfassende pharmazeutische Zusammensetzungen sowie ihre Verwendung zur Herstellung von Arzneimitteln, insbesondere zur Herstellung von antibakteriellen Arzneimitteln zur Behandlung von Menschen und Tieren.

Antibakteriell wirksame Heterocycll-substituierte Oxazolidon-Derivate sind im Stand der Technik bekannt (vgl. EP-A-0 697 412, EP-A-0 738 726 sowie EP-A-0 789 025). Diese in 3-Stellung durch heterocyclische Gruppen substituierten Oxazolidone weisen in der 5-Stellung einen Methylrest auf, der z.B. durch einen Thioharnstoff-, einen Amid-, einen Thioamid- oder einen Carbamatrest substituiert sein kann. Die Erfinder der vorliegenden Erfindung stellten sich die Aufgabe, neue Heterocycll-substituierte Oxazolidon-Derivate mit antibakterieller Wirksamkeit zu finden, und es gelang ihnen, neue Alkoxythiocarbonylaminomethyl-substituierte Oxazolidone zu finden, die über eine außerordentlich starke antibakterielle Wirksamkeit verfügen.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind daher Verbindungen der allgemeinen Formel (I):

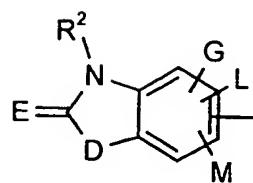


in welcher

25

R<sup>1</sup> (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl oder (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl ist,

A für einen Rest der Formel



steht,

5

worin

G, L und M gleich oder verschieden sind und

10

für Wasserstoff, Carboxy, Halogen, Cyano, Formyl, Trifluormethyl, Nitro, für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder für eine Gruppe der Formel  $-CO-NR^3R^4$  stehen,

worin

15

$R^3$  und  $R^4$  gleich oder verschieden sind und

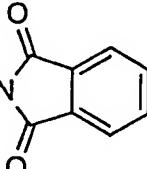
Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen oder Phenyl bedeuten,

20

$R^2$  Wasserstoff, Cycloalkylcarbonyl oder Cycloalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit jeweils bis zu 10 Kohlenstoffatomen bedeutet, die gegebenenfalls durch Cyano, Azido, Trifluormethyl, Pyridyl, Halogen, Hydroxy, Carboxyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Benzyloxycarbonyl, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 6

25

Kohlenstoffatomen und/oder durch eine Gruppe der Formel  
 $-(CO)_a-NR^5R^6$ ,       $R^7-N-SO_2-R^8$ ,       $R^9R^{10}-N-SO_2-$ ,

$R^{11}-S(O)_b-$  oder  substituiert sind,

5

worin

a      eine Zahl 0 oder 1 bedeutet,

10       $R^5$ ,  $R^6$  und  $R^7$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^3$  und  
 $R^4$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,  
 oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom einen 5- bis 6-  
 gliedrigen, gesättigten Heterocyclus mit gegebenenfalls  
 einem weiteren Heteroatom aus der Serie N, S und/oder  
 O bilden, der seinerseits gegebenenfalls, auch an einem  
 weiteren Stickstoffatom, durch geradkettiges oder ver-  
 zweigtes Alkyl oder Acyl mit bis zu 3 Kohlenstoff-  
 atomen substituiert sein kann,

15

20

$R^9$  und  $R^{10}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^3$  und  $R^4$   
 haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

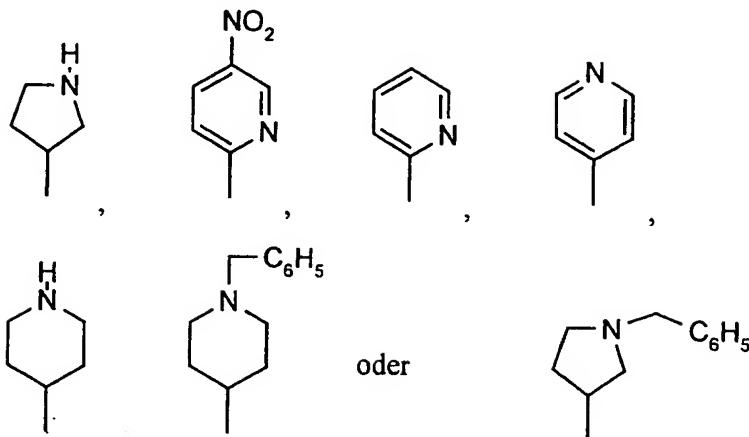
b      eine Zahl 0, 1 oder 2 bedeutet,

25

oder

$R^8$  und  $R^{11}$  gleich oder verschieden sind und  
 geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Koh-  
 lenstoffatomen, Benzyl, Phenyl oder Tolyl bedeuten,

R<sup>2</sup> einen Rest der Formeln



5

bedeutet oder

10

eine Gruppe der Formel -COCl<sub>3</sub> oder geradkettiges oder verzweigtes Acyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls Trifluormethyl, Trichlormethyl oder durch eine Gruppe der Formel -OR<sup>12</sup> substituiert ist,

worin

15

R<sup>12</sup> Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Aryl mit bis zu 10 Kohlenstoffatomen substituiert ist,

20

oder

R<sup>2</sup> eine Gruppe der Formel -(CO)<sub>e</sub>-NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, -NR<sup>15</sup>-SO<sub>2</sub>R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup>R<sup>18</sup>-N-SO<sub>2</sub>- oder R<sup>19</sup>-S(O)<sub>d</sub> bedeutet,

worin

- c die oben angegebene Bedeutung von a hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

5

$R^{13}$  und  $R^{14}$  und  $R^{15}$  jeweils die oben angegebene Bedeutung von  $R^5$ ,  $R^6$  und  $R^7$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

10

$R^{17}$  und  $R^{18}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^3$  und  $R^4$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

- d die oben angegebene Bedeutung von b hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

15

$R^{16}$  und  $R^{19}$  die jeweils oben angegebene Bedeutungen von  $R^8$  und  $R^{11}$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

20

D ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet,

E ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder eine Gruppe der Formel NH bedeutet,

25

oder im Fall, daß  $R^2$  nicht für Wasserstoff steht, E eine Gruppe der Formel -NR<sup>20</sup> bedeutet, worin R<sup>20</sup> mit Ausnahme von Wasserstoff die oben angegebene Bedeutung von  $R^2$  hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

30

oder

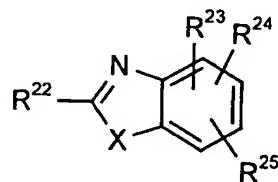
$R^{20}$  Cyano oder eine Gruppe der Formel -CO<sub>2</sub>R<sup>21</sup> bedeutet,

worin

R<sup>21</sup> Benzyl oder Phenyl bedeutet, die gegebenenfalls durch Nitro oder Halogen substituiert sind,

5

oder A für einen Rest der Formel



steht, in welchen

10

X für ein Sauerstoffatom oder für einen Rest der Formel -S(O)<sub>1</sub> steht,

worin

15

1 eine Zahl 0 oder 2 bedeutet,

R<sup>23</sup>, R<sup>24</sup> und R<sup>25</sup> gleich oder verschieden sind und

20

für Wasserstoff, Carboxy, Halogen, Cyano, Formyl, Trifluormethyl, Nitro, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen stehen, das seinerseits durch Hydroxy, durch geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy oder Acyl mit bis zu 5 Kohlenstoffatomen oder durch eine Gruppe der Formel -NR<sup>26</sup>R<sup>27</sup> substituiert sein kann,

25

worin

R<sup>26</sup> und R<sup>27</sup> gleich oder verschieden sind und

Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen oder Phenyl bedeuten,  
oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom einen 5- bis 6-gliedrigen, gesättigten Heterocyclus mit gegebenenfalls einem weiteren Heteroatom aus der Serie N, S und/oder O bilden, der seinerseits gegebenenfalls, auch an einem weiteren Stickstoffatom, durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,

- 5  
10                         und/oder  
                           gegebenenfalls für eine Gruppe der Formel -NR<sup>26</sup>'R<sup>27</sup>' stehen,  
                           worin  
15                         R<sup>26</sup>' und R<sup>27</sup>' gleich oder verschieden sind und die oben angegebene  
                           Bedeutung von R<sup>26</sup> und R<sup>27</sup> haben und mit dieser gleich oder  
                           verschieden sind,  
                           und/oder  
20                         gegebenenfalls für (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenylphenyl, Phenyl oder durch  
                           einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten  
                           Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N  
                           und/oder O stehen, die ihrerseits gegebenenfalls durch eine  
                           Gruppe der Formel -CO-NR<sup>28</sup>R<sup>29</sup>, NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup>, NR<sup>32</sup>-SO<sub>2</sub>-  
25                         R<sup>33</sup>, R<sup>34</sup>R<sup>35</sup>N-SO<sub>2</sub>- oder R<sup>36</sup>-S(O)<sub>f</sub>- substituiert sind,  
                           worin  
                           f             eine Zahl 0, 1 oder 2 bedeutet,  
30                         R<sup>28</sup>, R<sup>29</sup>, R<sup>32</sup>, R<sup>34</sup> und R<sup>35</sup> gleich oder verschieden sind und

Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Phenyl bedeuten,

5

R<sup>30</sup> und R<sup>31</sup> gleich oder verschieden sind und die oben angegebene Bedeutung von R<sup>26</sup> und R<sup>27</sup> haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

10

R<sup>33</sup> und R<sup>36</sup> gleich oder verschieden sind und für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen oder Phenyl bedeutet, das gegebenenfalls durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen substituiert ist,

15

und/oder ihrerseits gegebenenfalls bis zu 2-fach gleich oder verschieden durch Carboxy, Halogen, Cyano, Formyl, Trifluormethyl, Nitro, Phenyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sind, das seinerseits durch Hydroxy, durch geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy oder Acyl mit bis zu 5 Kohlenstoffatomen oder durch eine Gruppe der Formel -NR<sup>37</sup>R<sup>38</sup> substituiert sein kann,

20

25

worin

R<sup>37</sup> und R<sup>38</sup> die oben angegebene Bedeutung von R<sup>26</sup> und R<sup>27</sup> haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

30

R<sup>22</sup> für Wasserstoff, Formyl, Carboxy,

für geradkettiges oder verzweigtes Alkoxycarbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen steht, oder

für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit jeweils bis zu 8 Kohlenstoffatomen steht, die gegebenenfalls durch Hydroxy, Halogen oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Acyl, Alkylthio oder Alkoxycarbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Phenyl substituiert sind, das seinerseits durch Halogen substituiert sein kann, oder für Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen steht, das gegebenenfalls durch Carboxy, Halogen, Cyano, Formyl, Trifluormethyl, Nitro, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxy-carbonyl, Alkylthio oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert ist,

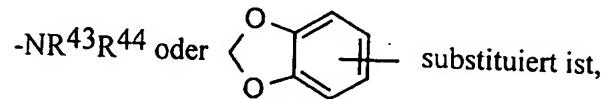
oder

für einen Rest der Formel  $-NR^{39}R^{40}$ ,  $-OR^{41}$  oder  $-S(O)_gR^{42}$  steht,

worin

$R^{39}$  Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, Phenyl, geradkettiges oder verzweigtes Acyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy oder Hydroxy substituiertes Alkoxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, durch einen 5- bis 6-gliedrigen aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O, oder durch Phenyl substituiert ist, das seinerseits durch Hydroxy, Trifluormethyl, Halogen, Nitro oder durch

geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann, oder Alkyl gegebenenfalls durch einen Rest der Formel

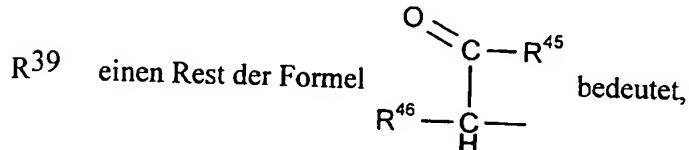


5

worin

$\text{R}^{43}$  und  $\text{R}^{44}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeuten, oder

10



worin

$\text{R}^{45}$  Hydroxy oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen oder einen Rest der Formel  $-\text{NR}^{47}\text{R}^{48}$  bedeutet, worin  $\text{R}^{47}$  und  $\text{R}^{48}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 5 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen oder Phenyl bedeuten

20

$\text{R}^{46}$  Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 7 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Indolyl, Hydroxy, Mercaptetyl, Imidazolyl, Methylthio, Amino, Phenyl, Hydroxy substituiertes Phenyl oder

25

durch einen Rest der Formel -CO-NH<sub>2</sub>, -CO<sub>2</sub>H

oder  $\begin{array}{c} \text{HN}=\text{C}- \\ | \\ \text{NH}_2 \end{array}$  substituiert ist, oder

5 R<sup>39</sup> einen Rest der Formel  N-(CH<sub>2</sub>)<sup>h</sup>- bedeutet,

worin

h eine Zahl 0, 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 bedeutet

10 Q ein Sauerstoffatom oder eine Gruppe der Formel  
-CH<sub>2</sub>- oder -NR<sup>49</sup>- bedeutet,

worin

15 R<sup>49</sup> Wasserstoff, Phenyl oder geradkettiges  
oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6  
Kohlenstoffatomen bedeutet, das gege-  
benenfalls durch Hydroxy substituiert  
ist,

und

20

R<sup>40</sup> die oben angegebene Bedeutung von R<sup>39</sup> hat und mit  
dieser gleich oder verschieden ist, oder  
Wasserstoff bedeutet,

25

R<sup>41</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8  
Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch  
geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy oder Hydroxy  
oder Alkoxy substituiertes Alkoxy mit jeweils bis zu 6

Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen oder einen 6-gliedrigen aromatischen, gegebenenfalls benzokondensierten Heterocyclus mit bis zu 4 Stickstoffatomen substituiert ist,

5

der seinerseits bis zu zweifach gleich oder verschieden durch Nitro, Trifluormethyl, Halogen, Cyano, Hydroxy oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy oder Acyl mit jeweils bis zu 5 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,

10

oder

R<sup>41</sup> einen Rest der Formel Q'  —(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub> bedeutet,

15

worin

i die oben angegebene Bedeutung von h hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

20

Q' die oben angegebene Bedeutung von Q hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

oder

25

R<sup>41</sup> Phenyl oder Pyridyl bedeutet,

g eine Zahl 0, 1 oder 2 bedeutet,

5

$R^{42}$  geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit bis zu 16 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Phenyl oder durch einen 5- bis 7-gliedrigen, aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N oder O substituiert ist, oder Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen 5- bis 7-gliedrigen aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N oder O bedeutet,

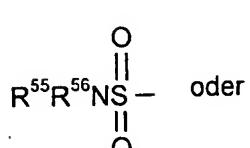
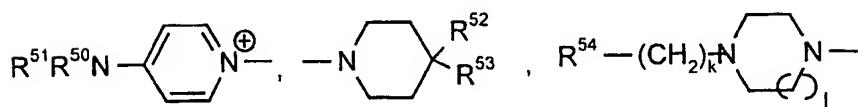
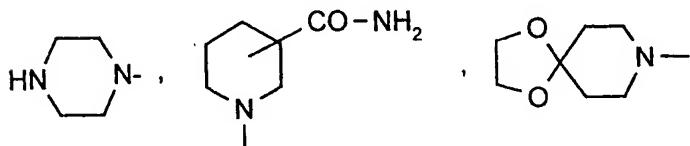
10 und wobei die oben aufgeführten Cyclen gegebenenfalls bis zu 2fach gleich oder verschieden durch Carboxy, Halogen, Cyano, Formyl, Trifluormethyl, Nitro, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxy carbonyl, Alkylthio oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sind

15

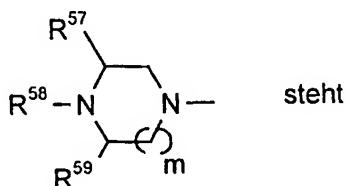
oder

20

$R^{22}$  für Morpholinyl oder für einen Rest der Formel



oder



steht

worin

5

$R^{50}$  und  $R^{51}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^{43}$  und  
 $R^{44}$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

10

$R^{52}$  und  $R^{53}$  gemeinsam einen Rest der Formel =O bilden

oder

15

$R^{52}$  und  $R^{53}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff,  
Hydroxy oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit  
bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten, das gegebenen-  
falls durch eine Gruppe der Formel  $-NR^{60}R^{61}$  substi-  
tuiert ist,

20

worin

$R^{60}$  und  $R^{61}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^{43}$   
und  $R^{44}$  haben und mit dieser gleich oder  
verschieden sind

l eine Zahl 0 oder 1 bedeutet,

k eine Zahl 0, 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 bedeutet,

25

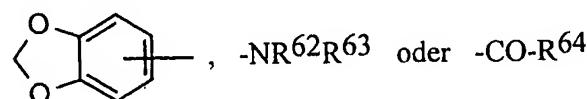
$R^{54}$  Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen  
5- bis 6-gliedrigen aromatischen, gegebenenfalls  
auch benzokondensierten Heterocyclus mit bis  
zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und oder  
O bedeuten, wobei alle Ringsysteme bis zu drei-  
fach, gleich oder verschieden durch Nitro,  
Cyano, Hydroxy, Phenyl, Halogen, Trifluor-

30

methyl oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy oder Acyl mit jeweils bis zu 5 Kohlenstoffatomen substituiert sein können, oder

5

R<sup>54</sup> Morpholinyl, Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder einen Rest der Formel



10

bedeutet,

worin

15

R<sup>62</sup> und R<sup>63</sup> gleich oder verschieden sind und die oben angegebene Bedeutung von R<sup>43</sup> und R<sup>44</sup> haben,

20

R<sup>64</sup> Morpholinyl, Hydroxy oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet,

25

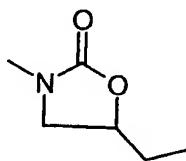
R<sup>55</sup> und R<sup>56</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Phenyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeutet,

R<sup>57</sup>, R<sup>58</sup> und R<sup>59</sup> gleich oder verschieden sind und die oben angegebene Bedeutung von R<sup>49</sup> haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

m eine Zahl 1 oder 2 bedeutet,  
und deren Salze.

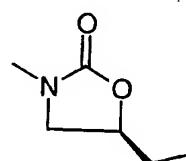
- 5 Die erfindungsgemäßen Verbindungen können in stereoisomeren Formen, die sich entweder wie Bild und Spiegelbild (Enantiomere), oder die sich nicht wie Bild und Spiegelbild (Diastereomere) verhalten, existieren. Die Erfindung betrifft sowohl die Enantiomeren oder Diastereomeren oder deren jeweilige Mischungen. Die Racemformen lassen sich ebenso wie die Diastereomeren in bekannter Weise in die stereoisomer einheitlichen Bestandteile trennen.
- 10

Folgendes Formelschema veranschaulicht die entsprechenden Schreibweisen für enantiomerenreine und racemische Formen des Oxazolidongerüstes:



15

(A) (racemisch)



(B) (enantiomer)

- Physiologisch unbedenkliche Salze der erfindungsgemäßen Verbindungen können Salze der erfindungsgemäßen Stoffe mit Mineralsäuren, Carbonsäuren oder Sulfonsäuren sein. Besonders bevorzugt sind z.B. Salze mit Chlorwasserstoffsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Methansulfonsäure, Ethansulfonsäure, Toluolsulfonsäure, Benzolsulfonsäure, Naphthalindisulfonsäure, Essigsäure, Propionsäure, Milchsäure, Weinsäure, Zitronensäure, Fumarsäure, Maleinsäure oder Benzoesäure.
- 20

- Als Salze können weiterhin Salze mit üblichen Basen genannt werden, wie beispielsweise Alkalimetallsalze (z.B. Natrium- oder Kaliumsalze), Erdalkalisalze (z.B.
- 25

Calcium- oder Magnesiumsalze) oder Ammoniumsalze, abgeleitet von Ammoniak oder organischen Aminen wie beispielsweise Diethylamin, Triethylamin, Ethyldiisopropylamin, Prokain, Dibenzylamin, N-Methylmorpholin, Dihydroabietylamin, 1-Ephenamin oder Methyl-piperidin.

5

(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl steht im Rahmen der Erfindung für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen wie z.B. Methyl, Ethyl, Propyl, Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl und Octyl sowie deren verzweigtkettige isomere Formen. Aus dieser Definition leiten sich analog die entsprechenden Alkylgruppen mit weniger Kohlenstoffatomen wie z.B. (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl ab. Im allgemeinen gilt, daß (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, besonders Methyl, bevorzugt ist.

10

Desweiteren leiten sich aus dieser Definition die entsprechenden Bedeutungen des Alkylanteils in funktionalisierten Gruppen ab, wie z.B. (C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>)-Alkinyl (z.B. Ethinyl, Propinyl etc.), (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkenyl (z.B. Vinyl, Propenyl etc.), (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Acyl (z.B. Formyl, Acetyl, Propionyl, Butyryl etc.), (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy (wie z.B. Methoxy, Ethoxy, Propoxy, Butoxy etc.), (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxycarbonyl (z.B. Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Propoxycarbonyl, Isopropoxycarbonyl, tert.Butoxycarbonyl, n-Pentoxycarbonyl, n-Hexoxycarbonyl etc.) etc.

15

(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)Cycloalkyl steht für einen cyclischen Kohlenwasserstoffrest mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen. Beispielsweise seien Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl genannt. Bevorzugt sind der Cyclopropyl-, Cyclopentan- und der Cyclohexanring.

20

Aryl steht im allgemeinen für einen aromatischen Rest mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen. Bevorzugte Arylreste sind Phenyl und Naphthyl.

25

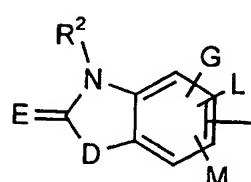
Halogen steht für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, wobei Fluor und Chlor bevorzugt sind.

In einer bevorzugten Ausführungsform betrifft die Erfindung Verbindungen der Formel (I), worin

$R^1$  ( $C_1-C_8$ )-Alkyl ist, und

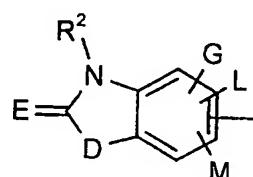
5

A für einen Rest der Formel



steht, worin G, L, M,  $R^2$ , D und E wie oben definiert sind,  
10 und deren Salze.

Weiterhin bevorzugt sind Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin A für



15

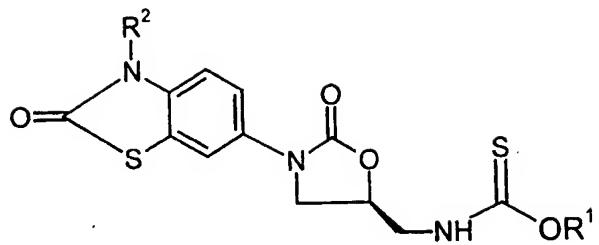
steht, worin G, L, M,  $R^2$ , D und E, wie oben definiert sind,  
und deren Salze, wobei Verbindungen, in denen D ein Schwefelatom und E ein  
Sauerstoffatom ist, bevorzugt sind.

20

Weiterhin sind erfindungsgemäß Verbindungen bevorzugt, in denen  $R^2$  ( $C_1-C_8$ )-Alkyl ist, sowie Verbindungen, worin G, L, M,  $R^{23}$ ,  $R^{24}$  und  $R^{25}$  für Wasserstoff stehen, und der Oxazolidonrest in den Positionen 5 oder 6 an den Phenylrest der Gruppe A gebunden ist.

25

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der folgenden Formel

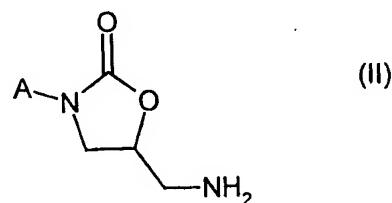


worin  $\text{R}^1$  und  $\text{R}^2$  unabhängig voneinander ( $\text{C}_1\text{-C}_8$ )-Alkyl sind oder ein Salz davon.

5

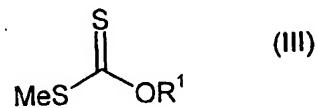
Die Erfindung betrifft ferner ein Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) oder eines Salzes davon, worin

a) Verbindungen der Formel (II)



10

worin A wie oben definiert ist, oder deren Salze mit Verbindungen der allgemeinen Formel (III)

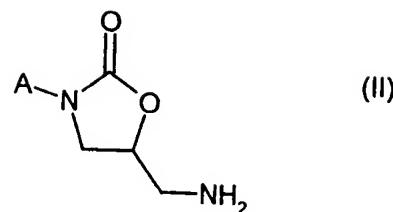


15

worin  $\text{R}^1$  wie oben definiert ist, umgesetzt werden, um Verbindungen der Formel (I) oder ein Salz davon zu erhalten oder

(b) Verbindungen der allgemeinen Formel (II)

20



worin A wie im oben definiert ist, in inerten Lösungsmitteln mit Verbindungen der Formel (IV)



5

worin A für Halogen, bevorzugt für Chlor, und R<sup>1</sup> wie oben definiert ist, steht, umgesetzt werden, um Verbindungen der Formel (I) oder deren Salz zu erhalten.

Die Herstellung der Ausgangsverbindungen der allgemeinen Formel (II) ist an sich bekannt, und die Herstellung dieser Aminverbindungen wird z.B. in dem in der Einleitung erwähnten Stand der Technik beschrieben. Ebenso handelt es sich bei der Verbindung der allgemeinen Formel (III) und (IV) um Verbindungen, die im Stand der Technik bekannt sind.

15 Gegenstand der Erfindung sind somit weiterhin pharmazeutische Zusammensetzungen, die mindestens eine Verbindung der Erfindung in einer Mischung mit mindestens einem pharmazeutisch vertäglichen Trägerstoff umfassen, sowie die Verwendung der Verbindungen der Erfindung zur Herstellung eines Medikamentes zur Behandlung bakterieller Infektionen bei Menschen oder Tieren.

20 Wie aus den folgenden Testergebnissen ersichtlich verfügen die Verbindungen der Erfindung über eine hohe antibakterielle Wirksamkeit, die der der analogen Verbindungen gemäß dem Stand der Technik, wie das Beispiel und die Vergleichsbeispiele zeigen, überlegen ist, was überraschend ist.

25 Dazu wurden die MHK-Werte mit Hilfe der Mikrodilutionsmethode in BH-Medium bestimmt. Jede Prüfsubstanz wurde im Nährmedium gelöst. In der Mikrotiterplatte

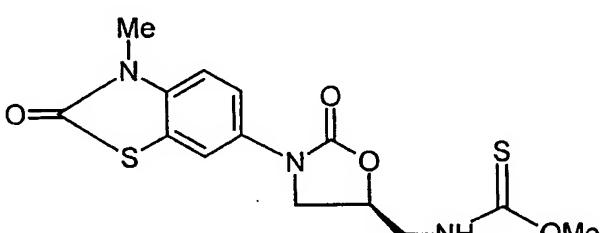
wurde durch serielle Verdünnung eine Konzentrationsreihe der Prüfsubstanzen angelegt. Zur Inokulation wurden Übernachtkulturen der Erreger verwandt, die zuvor im Nährmedium 1:250 verdünnt wurden. Zu 100 µl der verdünnten, wirkstoffhaltigen Nährösungen wurden je 100 µl Inokulationslösung gegeben.

5

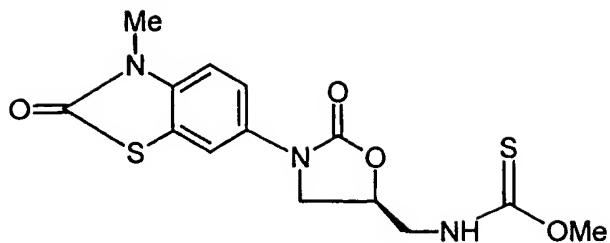
Die Mikrotiterplatten wurden bei 37°C bebrütet und nach ca. 20 Stunden oder nach 3 bis 5 Tagen abgelesen. Der MHK-Wert (µg/ml) gibt die niedrigste Wirkstoffkonzentration an, bei der kein Wachstum zu erkennen war.

10 Es wurden die folgenden Ergebnisse gefunden:

MHK-Werte (µg/ml):

Beispiel	MHK Staph.aureus 133
Bsp. 1: 	0.06

Vergleichsbeispiele	MHK Staph.aureus 133
Vgl.-Bsp. 1:	0.25
Vgl.-Bsp. 2 (Beispiel 70 der EP-A-0738726):	0.5
Vgl.-Bsp. 3 (Beispiel 18 der EP-A-0738726):	0.25

BeispieleBeispiel 1

5

(5S)-3-(3-Methyl-2-benzothiazolinon-6-yl)-5-(methoxythionocarbonyl-aminomethyl)-oxazolidin-2-on 190 mg (0,6 mmol) (5S)-3-(3-Methyl-2-benzothiazolinon-6-yl)-5-(aminomethyl)-oxazolidin-2-on

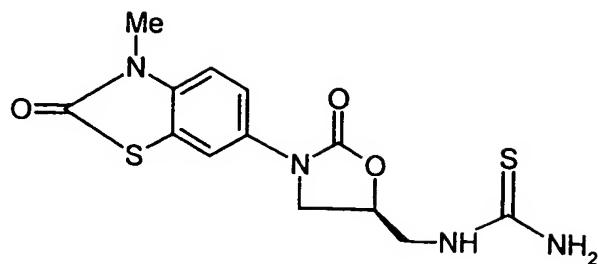
10

150 mg (1,2 mmol) Thionocarbonylmonomethyl-monothiomethylester, 0,37 ml (2,1 mmol) Hünigbase werden in 5 ml Methanol über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Der ausgefallene Niederschlag wird abgesaugt, mit Ether nachgewaschen und getrocknet.

15

Ausbeute: 116 mg, R<sub>F</sub> = 0,45

(Dichlormethan / Methanol 100:3)

Vergleichsbeispiel-Beispiel 1

5 (5S)-3-(3-Methyl-2-benzothiazolinon-6-yl)-5-(aminothionocarbonyl-aminomethyl)-  
oxazolidin-2-on

400 mg (1.23 mmol) (5S)-3-(3-Methyl-2-benzothiazolinon-6-yl)-5-(aminomethyl)-  
oxazolidin-2-on in 11 ml Chloroform/Wasser (1:1) werden bei 0°C mit 0,52 g (5.2  
10 mmol) Calciumcarbonat und 0.14 ml (1.9 mmol) Thiophosgen versetzt. Man röhrt  
über Nacht bei Raumtemperatur, wäscht die wäßrige Phase 3 x mit Chloroform, ver-  
einigt, trocknet und dampft ein. Der Rückstand wird in 36 ml Methanol aufgenom-  
men, mit 18 nl 2N Ammoniak/Methanol versetzt und über Nacht gerührt. Dann wird  
eingeengt, mit Dichlormethan verrührt, der Rückstand abfiltriert und getrocknet.

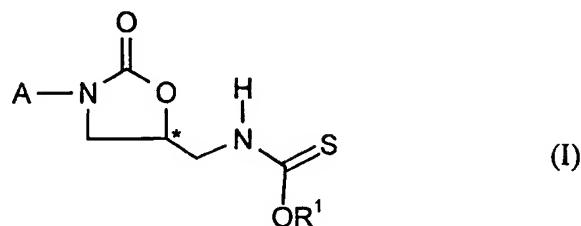
15

Ausbeute: 230 mg

$R_F = 0,73$  (Dichlormethan/Methanol 100:7)

Patentansprüche

## 1. Verbindungen der allgemeinen Formel (I)



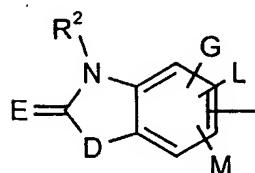
5

in welcher

R<sup>1</sup> (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl oder (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl ist,

10

A für einen Rest der Formel



steht,

15

worin

G, L und M gleich oder verschieden sind und

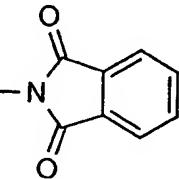
20

für Wasserstoff, Carboxy, Halogen, Cyano, Formyl, Trifluormethyl, Nitro, für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder für eine Gruppe der Formel -CO-NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup> stehen,

worin

$R^3$  und  $R^4$  gleich oder verschieden sind und

Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen oder Phenyl bedeuten,

- 5             $R^2$  Wasserstoff, Cycloalkylcarbonyl oder Cycloalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit jeweils bis zu 10 Kohlenstoffatomen bedeutet, die gegebenenfalls durch Cyano, Azido, Trifluormethyl, Pyridyl, Halogen, Hydroxy, Carboxyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy carbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Benzyloxycarbonyl, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen und/oder durch eine Gruppe der Formel
- 10             $-(CO)_a-NR^5R^6$ ,             $R^7-N-SO_2-R^8$ ,             $R^9R^{10}-N-SO_2-$ ,
- 15             $R^{11}-S(O)_b-$  oder  substituiert sind,

worin

- 20            a        eine Zahl 0 oder 1 bedeutet,

$R^5$ ,  $R^6$  und  $R^7$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^3$  und  $R^4$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind, oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom einen 5- bis 6-gliedrigen, gesättigten Heterocyclus mit gegebenenfalls einem weiteren Heteroatom aus der Serie N, S und/oder O bilden, der seinerseits gegebenenfalls, auch an einem weiteren Stickstoffatom, durch geradkettiges oder ver-

25

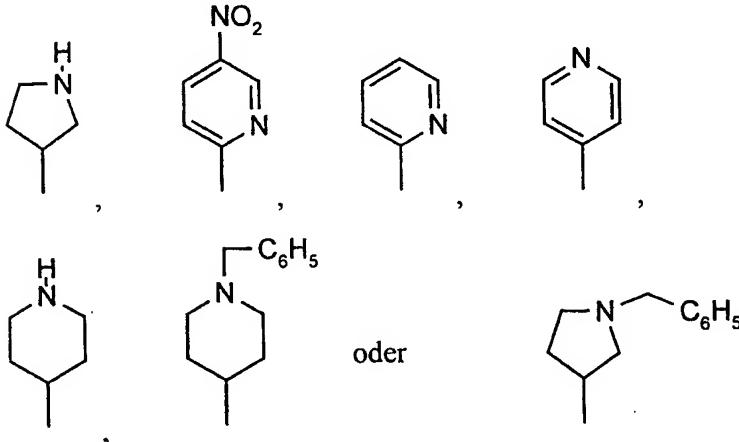
zweigtes Alkyl oder Acyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,

5                    R<sup>9</sup> und R<sup>10</sup> die oben angegebene Bedeutung von R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

b                 eine Zahl 0, 1 oder 2 bedeutet,

10                R<sup>8</sup> und R<sup>11</sup> gleich oder verschieden sind und geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen, Benzyl, Phenyl oder Tolyt bedeuten,  
oder

15                R<sup>2</sup> einen Rest der Formeln



bedeutet oder

20                eine Gruppe der Formel -COCl<sub>3</sub> oder geradkettiges oder verzweigtes Acyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls Trifluormethyl, Trichlormethyl oder durch eine Gruppe der Formel -OR<sup>12</sup> substituiert ist,

worin

5

R<sup>12</sup> Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Aryl mit bis zu 10 Kohlenstoffatomen substituiert ist,

10

oder

R<sup>2</sup> eine Gruppe der Formel -(CO)<sub>e</sub>-NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, -NR<sup>15</sup>-SO<sub>2</sub>R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup>R<sup>18</sup>-N-SO<sub>2</sub>- oder R<sup>19</sup>-S(O)<sub>d</sub> bedeutet,

15

worin

20

c die oben angegebene Bedeutung von a hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

25

R<sup>13</sup> und R<sup>14</sup> und R<sup>15</sup> jeweils die oben angegebene Bedeutung von R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

30

R<sup>17</sup> und R<sup>18</sup> die oben angegebene Bedeutung von R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

d die oben angegebene Bedeutung von b hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

35

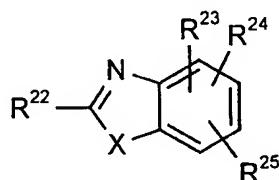
R<sup>16</sup> und R<sup>19</sup> die jeweils oben angegebene Bedeutungen von R<sup>8</sup> und R<sup>11</sup> haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

- D ein Sauerstoff oder Schwefelatom bedeutet,  
5 E ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder eine Gruppe der  
Formel NH bedeutet,

oder im Fall, daß R<sup>2</sup> nicht für Wasserstoff steht, E eine Gruppe der  
Formel -NR<sup>20</sup> bedeutet, worin R<sup>20</sup> mit Ausnahme von Wasserstoff  
die oben angegebene Bedeutung von R<sup>2</sup> hat und mit dieser gleich oder  
10 verschieden ist,

oder  
R<sup>20</sup> Cyano oder eine Gruppe der Formel -CO<sub>2</sub>R<sup>21</sup> bedeutet,  
worin  
15 R<sup>21</sup> Benzyl oder Phenyl bedeutet, die gegebenenfalls durch  
Nitro oder Halogen substituiert sind,

oder A für einen Rest der Formel



20

steht, in welchen

X für ein Sauerstoffatom oder für einen Rest der Formel -S(O)<sub>1</sub> steht,  
25 worin

1 eine Zahl 0 oder 2 bedeutet,

R<sup>23</sup>, R<sup>24</sup> und R<sup>25</sup> gleich oder verschieden sind und

5

für Wasserstoff, Carboxy, Halogen, Cyano, Formyl, Trifluormethyl, Nitro, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen stehen, das seinerseits durch Hydroxy, durch geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy oder Acyl mit bis zu 5 Kohlenstoffatomen oder durch eine Gruppe der Formel -NR<sup>26</sup>R<sup>27</sup> substituiert sein kann,

10

worin

R<sup>26</sup> und R<sup>27</sup> gleich oder verschieden sind und

15

Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen oder Phenyl bedeuten, oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom einen 5- bis 6gliedrigen, gesättigten Heterocyclus mit gegebenenfalls einem weiteren Heteroatom aus der Serie N, S und/oder O bilden, der seinerseits gegebenenfalls, auch an einem weiteren Stickstoffatom, durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Acyl mit bis zu 3 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,

20

und/oder

25

gegebenenfalls für eine Gruppe der Formel -NR<sup>26'</sup>R<sup>27'</sup> stehen,

worin

30

R<sup>26'</sup> und R<sup>27'</sup> gleich oder verschieden sind und die oben angegebene Bedeutung von R<sup>26</sup> und R<sup>27</sup> haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

und/oder

gegebenenfalls für (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenylphenyl, Phenyl oder durch einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O stehen, die ihrerseits gegebenenfalls durch eine Gruppe der Formel -CO-NR<sup>28</sup>R<sup>29</sup>, NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup>, NR<sup>32</sup>-SO<sub>2</sub>-R<sup>33</sup>, R<sup>34</sup>R<sup>35</sup>N-SO<sub>2</sub>- oder R<sup>36</sup>-S(O)f- substituiert sind,

5

worin

10

f eine Zahl 0, 1 oder 2 bedeutet,

15

R<sup>28</sup>, R<sup>29</sup>, R<sup>32</sup>, R<sup>34</sup> und R<sup>35</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Phenyl bedeuten,

20

R<sup>30</sup> und R<sup>31</sup> gleich oder verschieden sind und die oben angegebene Bedeutung von R<sup>26</sup> und R<sup>27</sup> haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

25

R<sup>33</sup> und R<sup>36</sup> gleich oder verschieden sind und für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen oder Phenyl bedeutet, das gegebenenfalls durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen substituiert ist,

30

und/oder ihrerseits gegebenenfalls bis zu 2-fach gleich oder verschieden durch Carboxy, Halogen, Cyano, Formyl, Trifluormethyl, Nitro, Phenyl, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder durch geradkettiges oder ver-

zweiges Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sind, das seinerseits durch Hydroxy, durch geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy oder Acyl mit bis zu 5 Kohlenstoffatomen oder durch eine Gruppe der Formel  $-NR^{37}R^{38}$  substituiert sein kann,

5

worin

10

$R^{37}$  und  $R^{38}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^{26}$  und  $R^{27}$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

15

$R^{22}$  für Wasserstoff, Formyl, Carboxy,  
für geradkettiges oder verzweigtes Alkoxycarbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen steht, oder

20

für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit jeweils bis zu 8 Kohlenstoffatomen steht, die gegebenenfalls durch Hydroxy, Halogen oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Acyl, Alkylthio oder Alkoxycarbonyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Phenyl substituiert sind, das seinerseits durch Halogen substituiert sein kann, oder für Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen steht, das gegebenenfalls durch Carboxy, Halogen, Cyano, Formyl, Trifluormethyl, Nitro, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxy-carbonyl, Alkylthio oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert ist,

oder

25

für einen Rest der Formel  $-NR^{39}R^{40}$ ,  $-OR^{41}$  oder  $-S(O)_g-R^{42}$  steht,

30

worin

5

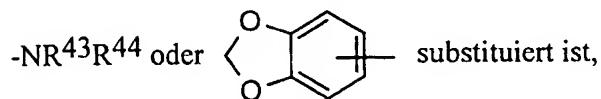
10

15

20

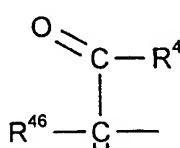
25

$R^{39}$  Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, Phenyl, geradkettiges oder verzweigtes Acyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy oder Hydroxy substituiertes Alkoxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, durch einen 5- bis 6-gliedrigen aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und/oder O, oder durch Phenyl substituiert ist, das seinerseits durch Hydroxy, Trifluormethyl, Halogen, Nitro oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann, oder Alkyl gegebenenfalls durch einen Rest der Formel



worin

$R^{43}$  und  $R^{44}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen bedeuten, oder

$R^{39}$  einen Rest der Formel  bedeutet,

worin

$R^{45}$  Hydroxy oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 4 Kohlenstoffatomen oder

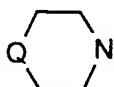
5

einen Rest der Formel  $-NR^{47}R^{48}$  bedeutet, worin  $R^{47}$  und  $R^{48}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 5 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen oder Phenyl bedeuten

10

$R^{46}$  Wasserstoff oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 7 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch Indolyl, Hydroxy, Mercaptyl, Imidazolyl, Methylthio, Amino, Phenyl, Hydroxy substituiertes Phenyl oder durch einen Rest der Formel  $-CO-NH_2$ ,  $-CO_2H$  oder  $\begin{matrix} HN=C \\ | \\ NH_2 \end{matrix}$  substituiert ist, oder

15

$R^{39}$  einen Rest der Formel   $N-(CH_2)^h-$  bedeutet,

worin

20

$h$  eine Zahl 0, 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 bedeutet

$Q$  ein Sauerstoffatom oder eine Gruppe der Formel  $-CH_2-$  oder  $-NR^{49}-$  bedeutet,

worin

25

$R^{49}$  Wasserstoff, Phenyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gege-

benenfalls durch Hydroxy substituiert ist,

und

5 R<sup>40</sup> die oben angegebene Bedeutung von R<sup>39</sup> hat und mit dieser gleich oder verschieden ist, oder Wasserstoff bedeutet,

10 R<sup>41</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 8 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy oder Hydroxy oder Alkoxy substituiertes Alkoxy mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen oder einen 6-gliedrigen aromatischen, gegebenenfalls benzokondensierten Heterocyclus mit bis zu 4 Stickstoffatomen substituiert ist,

15 der seinerseits bis zu zweifach gleich oder verschieden durch Nitro, Trifluormethyl, Halogen, Cyano, Hydroxy oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy oder Acyl mit jeweils bis zu 5 Kohlenstoffatomen substituiert sein kann,

oder

20

R<sup>41</sup> einen Rest der Formel Q'  N-(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub>— bedeutet,

worin

i die oben angegebene Bedeutung von h hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

5

Q' die oben angegebene Bedeutung von Q hat und mit dieser gleich oder verschieden ist,

oder

10

R<sup>41</sup> Phenyl oder Pyridyl bedeutet,

g eine Zahl 0, 1 oder 2 bedeutet,

15

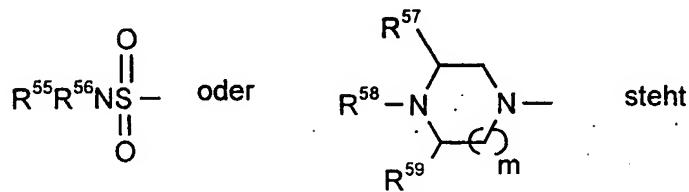
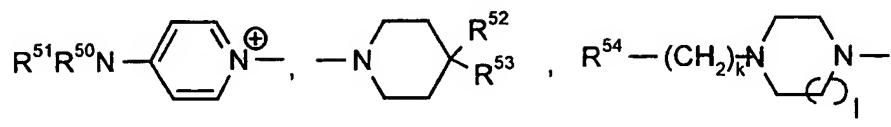
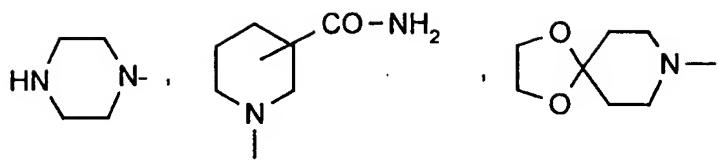
R<sup>42</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit bis zu 16 Kohlenstoffatomen bedeutet, das gegebenenfalls durch geradkettiges oder verzweigtes Alkoxycarbonyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Phenyl oder durch einen 5- bis 7-gliedrigen, aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N oder O substituiert ist, oder Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen 5- bis 7-gliedrigen aromatischen Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N oder O bedeutet, und wobei die oben aufgeführten Cyclen gegebenenfalls bis zu 2fach gleich oder verschieden durch Carboxy, Halogen, Cyano, Formyl, Trifluormethyl, Nitro, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio oder Acyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen substituiert sind

20

oder

25

R<sup>22</sup> für Morpholinyl oder für einen Rest der Formel



worin

5

$R^{50}$  und  $R^{51}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^{43}$  und  $R^{44}$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

$R^{52}$  und  $R^{53}$  gemeinsam einen Rest der Formel =O bilden

10

oder

$R^{52}$  und  $R^{53}$  gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Hydroxy oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeuten, das gegebenenfalls durch eine Gruppe der Formel  $-NR^{60}R^{61}$  substituiert ist,

15

worin

$R^{60}$  und  $R^{61}$  die oben angegebene Bedeutung von  $R^{43}$  und  $R^{44}$  haben und mit dieser gleich oder verschieden sind

5

- l eine Zahl 0 oder 1 bedeutet,
- k eine Zahl 0, 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 bedeutet,

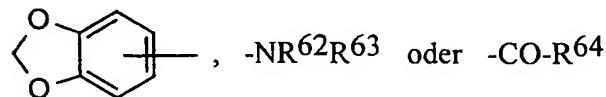
10

$R^{54}$  Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen oder einen 5- bis 6-gliedrigen aromatischen, gegebenenfalls auch benzokondensierten Heterocyclus mit bis zu 3 Heteroatomen aus der Reihe S, N und O bedeuten, wobei alle Ringsysteme bis zu dreifach, gleich oder verschieden durch Nitro, Cyano, Hydroxy, Phenyl, Halogen, Trifluormethyl oder durch geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy oder Acyl mit jeweils bis zu 5 Kohlenstoffatomen substituiert sein können, oder

15

20

$R^{54}$  Morphinyl, Hydroxy, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder einen Rest der Formel



bedeutet,

25

worin

R<sup>62</sup> und R<sup>63</sup> gleich oder verschieden sind und die oben angegebene Bedeutung von R<sup>43</sup> und R<sup>44</sup> haben,

5

R<sup>64</sup> Morpholinyl, Hydroxy oder geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen bedeutet,

10

R<sup>55</sup> und R<sup>56</sup> gleich oder verschieden sind und Wasserstoff, Phenyl oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit bis zu 6 Kohlenstoffatomen oder Benzyl bedeutet,

15

R<sup>57</sup>, R<sup>58</sup> und R<sup>59</sup> gleich oder verschieden sind und die oben angegebene Bedeutung von R<sup>49</sup> haben und mit dieser gleich oder verschieden sind,

m eine Zahl 1 oder 2 bedeutet,

und deren Salze.

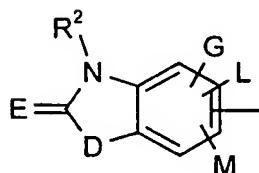
20

2. Verbindungen nach Anspruch 1, worin

R<sup>1</sup> (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl ist,

25

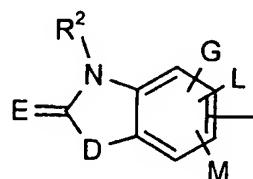
A für einen Rest der Formel



steht,

worin G, L, M, R<sup>2</sup>, D und E wie oben definiert sind,  
und deren Salze.

- 5        3. Verbindungen nach Anspruch 1 oder 2, worin A für



- 10      steht und worin G, L, M, R<sup>2</sup>, D und E, wie oben definiert sind,  
und deren Salze.

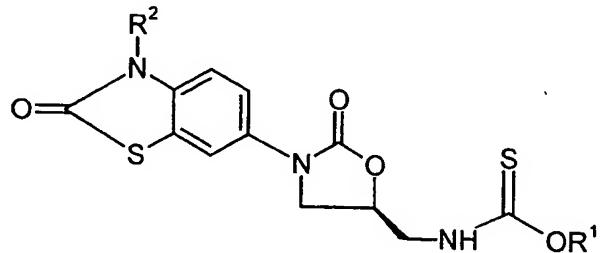
4. Verbindungen nach Anspruch 3, worin D ein Schwefelatom und E ein  
Sauerstoffatom ist.

- 15      5. Verbindungen nach Anspruch 3 oder 4, worin R<sup>2</sup> (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl ist,

6. Verbindungen nach Anspruch 1, worin G, L, M, R<sup>27</sup>, R<sup>28</sup> und R<sup>29</sup> für  
Wasserstoff stehen, und der Oxazolidonrest in den Positionen 5 oder 6 an den  
Phenylrest der Gruppe A gebunden ist.

20

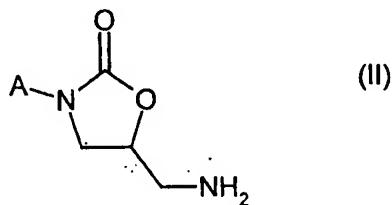
7. Verbindungen nach Anspruch 1 der folgenden Formel



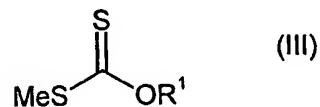
worin R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> unabhängig voneinander (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl sind oder ein Salz davon.

8. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch  
5 1 oder eines Salzes davon, worin

a) Verbindungen der Formel (II)

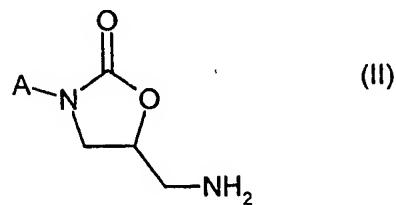


10 worin A wie im Anspruch 1 definiert ist, oder deren Salze mit  
Verbindungen der allgemeinen Formel (III)

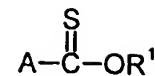


15 worin R<sup>1</sup> wie im Anspruch 1 definiert ist, umgesetzt werden, um  
Verbindungen der Formel (I) oder ein Salz davon zu erhalten oder

(b) Verbindungen der allgemeinen Formel (II)



20 worin A wie im Anspruch 1 definiert ist, in inerten Lösungsmitteln  
mit Verbindungen der Formel (IV)



5

worin A für Halogen, bevorzugt für Chlor, und R<sup>1</sup> wie oben definiert ist, steht, umgesetzt werden, um Verbindungen der Formel (I) oder deren Salz zu erhalten.

9. Verbindungen nach Anspruch 1 zur Verwendung als Arzneimittel.
10. Pharmazeutische Zusammensetzung, die eine Verbindung nach Anspruch 1 in einer Mischung mit mindestens einem pharmazeutisch verträglichen Trägerstoff umfaßt.
11. Verwendung der Verbindung nach Anspruch 1 zur Herstellung eines Medikamentes zur Behandlung bakterieller Infektionen bei Menschen oder Tieren.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Interr. 1st Application No

PCT/EP 99/08468

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
**IPC 7 C07D417/04 A61K31/425 A61K31/42**

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
**IPC 7 C07D**

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used)

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	US 5 792 765 A (RIEGL ET. AL.) 11 August 1998 (1998-08-11) cited in the application claims; examples 20,21,26,39-42	1-11
Y	EP 0 738 726 A (BAYER) 23 October 1996 (1996-10-23) cited in the application claims; examples 71-75,117,118,130,139-141,151-153	1-11
A	EP 0 697 412 A (BAYER) 21 February 1996 (1996-02-21) cited in the application claims; examples	1-11

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

\* Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the International filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the International filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the International filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the International search

**21 February 2000**

Date of mailing of the International search report

**28/02/2000**

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Fax. 31 651 epo nl,  
Fax (+31-70) 340-3018

Authorized officer

**Helps, I**

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP 99/08468

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,X	WO 98 54161 A (PHARMACIA AND UPJOHN) 3 December 1998 (1998-12-03) claims	1-11
P,X	WO 99 40094 A (BAYER) 12 August 1999 (1999-08-12) claims; examples 39,40,44,49	1-11

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 99/08468

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 5792765	A 11-08-1998	DE 19604223 A AU 1251697 A BG 101193 A BR 9700885 A CA 2196862 A CN 1160051 A CZ 9700340 A EP 0789025 A HR 970048 A HU 9700358 A JP 9316073 A NO 970511 A NZ 314179 A PL 318277 A SG 50791 A SK 15897 A TR 9700092 A	07-08-1997 14-08-1997 26-02-1999 27-10-1998 07-08-1997 24-09-1997 13-08-1997 13-08-1997 30-04-1998 28-07-1998 09-12-1997 07-08-1997 23-12-1998 18-08-1997 20-07-1998 08-10-1997 21-08-1997
EP 738726	A 23-10-1996	DE 19544106 A AU 705071 B AU 5073596 A BG 100525 A BR 9602016 A CA 2174473 A CN 1138582 A CZ 9601142 A HR 960159 A HU 9601001 A JP 8301869 A NO 961559 A NZ 286400 A SG 52774 A SK 50096 A TR 960963 A ZA 9603138 A	24-10-1996 13-05-1999 31-10-1996 31-03-1997 07-04-1998 22-10-1996 25-12-1996 16-07-1996 31-08-1997 28-04-1998 19-11-1996 22-10-1996 27-04-1998 28-09-1998 07-05-1997 21-11-1996 04-11-1996
EP 697412	A 21-02-1996	DE 19514313 A AU 698939 B AU 2723095 A BG 62404 B BG 99833 A CN 1122803 A CZ 9501988 A DE 59507595 D FI 953665 A HR 950428 A HU 75037 A JP 8081463 A NO 953045 A NZ 272674 A PL 309848 A SK 97495 A US 5529998 A ZA 9506445 A	08-02-1996 12-11-1998 15-02-1996 29-10-1999 29-02-1996 22-05-1996 14-02-1996 17-02-2000 04-02-1996 31-08-1997 28-03-1997 26-03-1996 05-02-1996 24-02-1997 05-02-1996 05-06-1996 25-06-1996 22-03-1996
WO 9854161	A 03-12-1998	AU 7488398 A	30-12-1998
WO 9940094	A 12-08-1999	DE 19805117 A	12-08-1999

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No  
PCT/EP 99/08468

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9940094	A	AU 2519599 A	23-08-1999

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Intern. Aktenzeichen:

PCT/EP 99/08468

**A. KLASSEIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES**  
**IPK 7 C07D417/04 A61K31/425 A61K31/42**

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

**B. RECHERCHIERTE GEBIETE**

Recherchierte Mindestdruckstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
**IPK 7 C07D**

Recherchierte aber nicht zum Mindestdruckstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

**C. ALS WESENTLICH ANGEBEHNE UNTERLAGEN**

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	US 5 792 765 A (RIEDL ET. AL.) 11. August 1998 (1998-08-11) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche; Beispiele 20,21,26,39-42	1-11
Y	EP 0 738 726 A (BAYER) 23. Oktober 1996 (1996-10-23) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche; Beispiele 71-75, 117, 118, 130, 139-141, 151-153	1-11
A	EP 0 697 412 A (BAYER) 21. Februar 1996 (1996-02-21) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche; Beispiele	1-11

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :  
 "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besondere bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem Internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung,

eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem Internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem Internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"V" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der Internationalen Recherche

Anmeldedatum des Internationalen Recherchenberichts

21. Februar 2000

28/02/2000

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde  
 Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 661 epo nl,  
 Fax. (+31-70) 340-3018

Bevollmächtigter Belehrer/Notar

Helps, I

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Intern  das Aktenzeichen  
PCT/EP 99/08468

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGEBEHENDE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P,X	<b>WO 98 54161 A (PHARMACIA AND UPJOHN)</b> <b>3. Dezember 1998 (1998-12-03)</b> <b>Ansprüche</b> —	1-11
P,X	<b>WO 99 40094 A (BAYER)</b> <b>12. August 1999 (1999-08-12)</b> <b>Ansprüche; Beispiele 39,40,44,49</b> —	1-11

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Intern. Aktenzeichen

PCT/EP 99/08468

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 5792765	A	11-08-1998	DE 19604223 A AU 1251697 A BG 101193 A BR 9700885 A CA 2196862 A CN 1160051 A CZ 9700340 A EP 0789025 A HR 970048 A HU 9700358 A JP 9316073 A NO 970511 A NZ 314179 A PL 318277 A SG 50791 A SK 15897 A TR 9700092 A	07-08-1997 14-08-1997 26-02-1999 27-10-1998 07-08-1997 24-09-1997 13-08-1997 13-08-1997 30-04-1998 28-07-1998 09-12-1997 07-08-1997 23-12-1998 18-08-1997 20-07-1998 08-10-1997 21-08-1997
EP 738726	A	23-10-1996	DE 19544106 A AU 705071 B AU 5073596 A BG 100525 A BR 9602016 A CA 2174473 A CN 1138582 A CZ 9601142 A HR 960159 A HU 9601001 A JP 8301869 A NO 961559 A NZ 286400 A SG 52774 A SK 50096 A TR 960963 A ZA 9603138 A	24-10-1996 13-05-1999 31-10-1996 31-03-1997 07-04-1998 22-10-1996 25-12-1996 16-07-1996 31-08-1997 28-04-1998 19-11-1996 22-10-1996 27-04-1998 28-09-1998 07-05-1997 21-11-1996 04-11-1996
EP 697412	A	21-02-1996	DE 19514313 A AU 698939 B AU 2723095 A BG 62404 B BG 99833 A CN 1122803 A CZ 9501988 A DE 59507595 D FI 953665 A HR 950428 A HU 75037 A JP 8081463 A NO 953045 A NZ 272674 A PL 309848 A SK 97495 A US 5529998 A ZA 9506445 A	08-02-1996 12-11-1998 15-02-1996 29-10-1999 29-02-1996 22-05-1996 14-02-1996 17-02-2000 04-02-1996 31-08-1997 28-03-1997 26-03-1996 05-02-1996 24-02-1997 05-02-1996 05-06-1996 25-06-1996 22-03-1996
WO 9854161	A	03-12-1998	AU 7488398 A	30-12-1998
WO 9940094	A	12-08-1999	DE 19805117 A	12-08-1999

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Intern. Aktenzeichen

PCT/EP 99/08468

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9940094 A	AU 2519599 A		23-08-1999